

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】平成24年12月27日(2012.12.27)

【公表番号】特表2011-504939(P2011-504939A)  
 【公表日】平成23年2月17日(2011.2.17)  
 【年通号数】公開・登録公報2011-007  
 【出願番号】特願2010-542542(P2010-542542)  
 【国際特許分類】

C 0 7 C 237/46 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 237/46 C S P

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月2日(2011.11.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

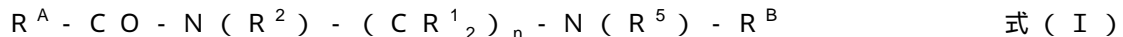
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次の式(I)の化合物及びその塩又は光学活性異性体。



式中、

各 $R^1$ は独立に同一又は異なるもので、水素原子、ヒドロキシル基、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖又は枝分れアルキル基或いは $C_1 \sim C_4$ 直鎖又は枝分れオキシアルキル基を表し、

$R^2$ は水素原子或いは $C_1 \sim C_4$ 直鎖又は枝分れアルキル基を表し、

$R^5$ は式 $-CO-R^4$ (式中、 $R^4$ は水素、又は1~4のヒドロキシル部分で任意に置換された $C_1 \sim C_4$ 直鎖又は枝分れアルキル基を表す。)の基を表し、

$R^A$ 及び $R^B$ は独立に同一又は異なるもので、三ヨウ素化フェニル基、好ましくはさらに3位及び5位において2つの $R^3$ 基で置換された2,4,6-三ヨウ素化フェニル基を表し、ここで各 $R^3$ は同一又は異なるもので、式(I)の化合物中の少なくとも1つの $R^3$ 基が親水性部分であることを条件にして水素原子又は非イオン性の親水性部分を表し、

$n$ は1~6の正の整数を表す。

【請求項2】

各 $R^1$ 基が水素原子及び/又はヒドロキシル基を表す、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

$R^2$ 基が水素原子又はメチル基を表す、請求項1又は請求項2記載の化合物。

【請求項4】

$R^5$ が式 $-CHO$ 、 $-COCH_3$ 、 $-COCH_2-OH$ 及び $-CO-CHOH-CH_2-OH$ のアシル基のいずれかを表す、請求項1乃至請求項3のいずれか1項記載の化合物。

【請求項5】

$R^5$ がホルミル又はアセチル残基を表す、請求項1乃至請求項4のいずれか1項記載の化合物。

【請求項6】

$n$ が2~5の整数を表す、請求項1乃至請求項5のいずれか1項記載の化合物。

【請求項7】

各 $R^3$ が同一又は異なるもので、エステル、アミド及びアミン部分を含み、任意にはさらに直鎖又は枝分れ $C_{1-10}$ アルキル基、好ましくは $C_{1-5}$ アルキル基で置換され、アルキ

ル基は1以上の $\text{CH}_2$ 又は $\text{CH}$ 部分が酸素又は窒素原子で置き換えられていてもよい非イオン性の親水性部分であり、さらにオキソ、ヒドロキシル、アミノ又はカルボキシル誘導体並びにオキソ置換硫黄及びリン原子から選択される1以上の基を含んでいてもよい非イオン性の親水性部分を表す、請求項1乃至請求項6のいずれか1項記載の化合物。

【請求項8】

$\text{R}^3$ 置換基が同一又は異なるもので、ポリヒドロキシ $\text{C}_{1-5}$ アルキル、炭素原子数1~5のヒドロキシアルコキシアリル及び炭素原子数1~5のヒドロキシポリアルコキシアリルであり、アミド結合又はカルバモイル結合を介してヨウ素化フェニル基に結合している、請求項7記載の化合物。

【請求項9】

$\text{R}^3$ 基が以下の式の基のいずれかである、請求項8記載の化合物。

- $\text{CONH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH}$ 、
- $\text{CONH}-\text{CH}_2-\text{CHOH}-\text{CH}_2-\text{OH}$ 、
- $\text{CON}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH}$ 、
- $\text{CONH}-\text{CH}-(\text{CH}_2-\text{OH})_2$ 、
- $\text{CON}-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH})_2$ 、
- $\text{CONH}_2$ 、
- $\text{CONHCH}_3$ 、
- $\text{NHCOCH}_2\text{OH}$ 、
- $\text{N}(\text{COCH}_3)\text{H}$ 、
- $\text{N}(\text{COCH}_3)-\text{C}_{1-3}$ アルキル、
- $\text{N}(\text{COCH}_3)-$ モノ、ビス又はトリス-ヒドロキシ $\text{C}_{1-4}$ アルキル、
- $\text{N}(\text{COCH}_2\text{OH})-$ 水素、モノ、ビス又はトリス-ヒドロキシ $\text{C}_{1-4}$ アルキル、
- $\text{N}(\text{CO}-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH})-$ 水素、モノ、ビス又はトリヒドロキシル化 $\text{C}_{1-4}$ アルキル、
- $\text{N}(\text{CO}-\text{CHOH}-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH})-$ 水素、モノ、ビス又はトリヒドロキシル化 $\text{C}_{1-4}$ アルキル、
- $\text{N}(\text{COCH}_2\text{OH})_2$ 、
- $\text{CON}(\text{CH}_2-\text{CHOH}-\text{CH}_2-\text{OH})(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH})$ 、
- $\text{CONH}-\text{C}(\text{CH}_2-\text{OH})_3$ 、及び
- $\text{CONH}-\text{CH}(\text{CH}_2-\text{OH})(\text{CHOH}-\text{CH}_2-\text{OH})$ 。

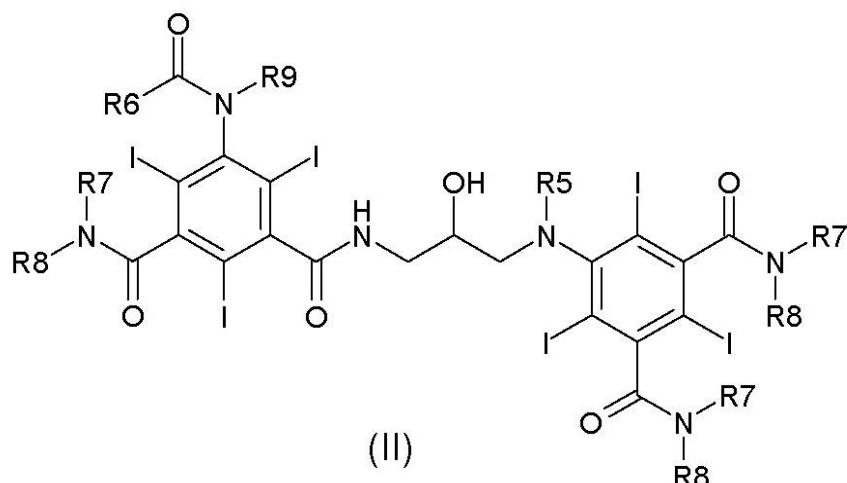
【請求項10】

各 $\text{R}^3$ 基が同一又は異なるもので、式 $-\text{CONH}-\text{CH}_2-\text{CHOH}-\text{CH}_2-\text{OH}$ 、 $-\text{CON}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CONH}-\text{CH}-(\text{CH}_2-\text{OH})_2$ 、 $-\text{CON}-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OH})_2$ 、 $-\text{CON}(\text{CHOH}-\text{CH}_2-\text{OH})(\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{OH})$ 、 $-\text{NH}-\text{COCH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH}$ 及び $-\text{NH}-\text{CO}-\text{CHOH}-\text{CHOH}-\text{CH}_2\text{OH}$ を有する1以上の部分を表す、請求項9記載の化合物。

【請求項11】

次の式(II)を有する、請求項1乃至請求項10のいずれか1項記載の化合物。

## 【化 1】



式中、 $R^6$ は $-CH_2-OH$ 、 $-CHOH-CH_2-OH$ 又は $CHOH-CHOH-CH_2-OH$ 部分を表し、 $R^9$ は $H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 又は $-CH_2-CH(OH)-CH_2-OH$ を表し、 $R^7$ 及び $R^8$ の各々は同一又は異なるもので、 $H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 又は $-CH_2-CH(OH)-CH_2-OH$ を表し、 $R^5$ はホルミル又はアセチル残基を表す。

## 【請求項 1 2】

以下の化合物から選択されるものである、請求項 1 乃至請求項 1 1 のいずれか 1 項記載化合物。

5 - { [ 3 - ( 3 - ヒドロキシメチルアミノ - 5 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) アミノカルボニル ] - 2 , 4 , 6 - トリヨードベンゾイルアミノ ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] アセチルアミノ } - N , N ' - ビス ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - 2 , 4 , 6 - トリヨードイソフタルアミド、

5 - { [ 3 - ( 3 , 4 - ジヒドロキシエチルアミノ - 5 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) アミノカルボニル ] - 2 , 4 , 6 - トリヨードベンゾイルアミノ ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] アセチルアミノ } - N , N ' - ビス ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - 2 , 4 , 6 - トリヨードイソフタルアミド、

5 - { [ 3 - ( 3 - ヒドロキシメチルアミノ - 5 - [ N ' - ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - N ' - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アミノカルボニル ] - 2 , 4 , 6 - トリヨードベンゾイルアミノ ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] アセチルアミノ } - N , N ' - ビス ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - 2 , 4 , 6 - トリヨードイソフタルアミド、

5 - { [ 3 - ( 3 , 4 - ジヒドロキシエチルアミノ - 5 - [ N ' - ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - N ' - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アミノカルボニル ] - 2 , 4 , 6 - トリヨードベンゾイルアミノ ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] アセチルアミノ } - N , N ' - ビス ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - 2 , 4 , 6 - トリヨードイソフタルアミド、及び

5 - { [ 3 - ( 3 - ヒドロキシメチルアミノ - 5 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) アミノカルボニル ] - 2 , 4 , 6 - トリヨードベンゾイルアミノ ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] ホルミルアミノ } - N , N ' - ビス ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - 2 , 4 , 6 - トリヨードイソフタルアミド。

## 【請求項 1 3】

請求項 1 乃至請求項 1 2 のいずれか 1 項記載の式 ( I ) 又は式 ( I I ) の化合物を薬学的に許容されるキャリアー又は賦形剤と共に含んでなる X 線診断用組成物。

## 【請求項 1 4】

請求項 1 乃至請求項 1 2 のいずれか 1 項記載の式 ( I ) 又は式 ( I I ) の化合物を含む診断剤及び診断用組成物の、X 線造影検査における使用。

## 【請求項 15】

請求項 1 乃至請求項 1 2 のいずれか 1 項記載の式 ( I ) 又は式 ( I I ) の化合物をヒト又は動物の身体に投与する段階、診断装置で身体を検査する段階、検査からのデータをコンパイルする段階、及び任意にはデータを解析する段階を含んでなるイメージング方法。

## 【請求項 16】

請求項 1 乃至請求項 1 2 のいずれか 1 項記載の式 ( I ) 又は式 ( I I ) の化合物をヒト又は動物の身体に投与する段階、X 線診断装置で身体を検査する段階、検査からのデータをコンパイルする段階、及び任意にはデータを解析する段階を含んでなる X 線イメージング方法。